

外用抗真菌剤

ケトコナゾール

日本薬局方 ケトコナゾールローション

ニゾラル® ローション2%

Nizoral Lotion 2%

承認番号	21500AMZ00206
販売開始	2003年7月

貯法：室温保存
有効期間：2年

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	(1g中) 日局ケトコナゾール 20mg
添加剤	ミリスチン酸オクチルドデシル、ステアリルアルコール、スクワラン、モノステアリン酸グリセリン、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 60、ポリオキシエチレンセチルエーテル、酢酸トコフェロール、ジブチルヒドロキシトルエン、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、キサンタンガム、1,3-ブチレングリコール

3.2 製剤の性状

色・剤形	白色のローション剤
------	-----------

4. 効能又は効果

下記の皮膚真菌症の治療

- 白癬：足白癬、体部白癬、股部白癬
- 皮膚カンジダ症：指間糜爛症、間擦疹（乳児寄生菌性紅斑を含む）
- 癬風
- 脂漏性皮膚炎

6. 用法及び用量

〈白癬、皮膚カンジダ症、癬風〉

白癬、皮膚カンジダ症、癬風に対しては、1日1回患部に塗布する。

〈脂漏性皮膚炎〉

脂漏性皮膚炎に対しては、1日2回患部に塗布する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

2%ケトコナゾールクリームは、皮膚からはほとんど吸収されないが、経口投与における動物実験で催奇形作用が報告されている¹⁾。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	頻度不明
皮膚	刺激感	そう痒、接触皮膚炎、紅斑、水疱	皮膚灼熱感、発疹、皮膚剥脱、皮膚のべとつき感、蕁麻疹、糜爛、亀裂、疼痛
全身障害及び投与局所様態			適用部位反応（出血、不快感、乾燥、炎症、錯覚、浮腫）
免疫系障害			過敏症
その他		尿蛋白陽性	

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

- 14.1.1 よく振って使用すること。
- 14.1.2 眼科用として角膜、結膜に使用しないこと。
- 14.1.3 著しい糜爛面には使用しないこと。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

2%ケトコナゾールクリーム 5g を健康成人の背部に単純塗布した時、ケトコナゾールの血中濃度は検出限界（1ng/mL）以下であった²⁾。

16.3 分布

血漿蛋白結合率：98.9%（平衡透析法）

16.5 排泄

2%ケトコナゾールクリーム 5g を健康成人の背部に単純塗布した時、尿中への未変化体の排泄は検出限界（1ng/mL）以下であった²⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈脂漏性皮膚炎〉

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

ローション剤 61 例、クリーム剤 63 例において以下の臨床効果が示された³⁾。

疾患名	(ローション) 改善率 (改善以上症例数/症例数)	(クリーム) 改善率 (改善以上症例数/症例数)
脂漏性皮膚炎	73.8% (45/61)	71.4% (45/63)

ローション剤における安全性評価対象例 69 例中、副作用は 11 例（15.9%）に計 16 件が認められた。内訳は、刺激感 8 件（11.6%）、そう痒 3 件（4.3%）、尿蛋白陽性 2 件（2.9%）、接触皮膚炎 1 件（1.4%）、紅斑 1 件（1.4%）、小水疱 1 件（1.4%）であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

真菌の細胞膜の構成成分であるエルゴステロールの生合成阻害作用を介して抗真菌作用を示す⁴⁾。

18.2 抗真菌作用

ケトコナゾールは皮膚糸状菌（*Trichophyton* 属、*Microsporum* 属、*Epidermophyton* 属）、*Candida* 属、癬風菌（*Malassezia furfur*）に対して強い抗真菌作用を示した⁵⁾。

18.3 実験的治療効果

モルモット実験的白癬（*Trichophyton mentagrophytes* 感染）モデルに対し、感染後7日目からケトコナゾールローションを1日1回塗布した実験では、2週間の塗布で高い治療効果を示した。また、同様にモルモット実験的カンジダ症（*Candida albicans* 感染）モデルに対しても優れた治療効果を示した。^{6)、7)}

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ケトコナゾール (ketoconazole)

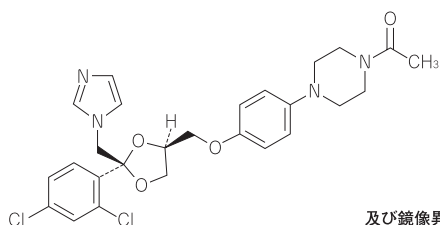
化学名：1-Acetyl-4- (4- [(2*RS*, 4*SR*) -2- (2, 4-dichlorophenyl) -2- (1*H*-imidazol-1-ylmethyl) -1, 3-dioxolan-4-yl] methoxy)phenyl) piperazine

分子式：C₂₆H₂₈Cl₂N₄O₄

分子量：531.43

性状：白色～淡黄白色の粉末で、においはない。

化学構造式：



融点：148～152℃

溶解性：酢酸 (100) 又はクロロホルムに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール (99.5) にやや溶けにくく、アセトン又は2-プロパノールに溶けにくく、ジエチルエーテル又は水にほとんど溶けない。

20. 取扱い上の注意

小児の手の届かない所に保管すること。

22. 包装

10本 [10g (ボトル) ×10]

23. 主要文献

- 1) 西川智, 他: 基礎と臨床. 1984; 18, 1433-1448
- 2) 小林孝志, 他: 薬理と治療. 1991; 19, 1857-1861
- 3) 五十嵐敦之, 他: 臨床医薬, 2003; 19, 355-369
- 4) Vanden Bossche H, et al.: Br J Clin Pract. 1990; 44 (Suppl. 71) ,41-46
- 5) Van Cutsem J, et al.: Am J Med. 1983; 74 (1B) ,9-15
- 6) 社内資料: 角田英信, 他: モルモット実験的白癬モデルを用いた薬効薬理試験
- 7) 社内資料: 角田英信, 他: モルモット実験的カンジダ症モデルを用いた薬効薬理試験

* 24. 文献請求先及び問い合わせ先

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

岩城製薬株式会社 学術部

〒103-8434 東京都中央区日本橋小網町19-8

TEL 03-3668-1574 FAX 03-3668-5282

* 26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



岩城製薬株式会社

東京都中央区日本橋本町4-8-2

(参考情報)

